## INSTITUT NATIONAL DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE

**PARIS** 

11) N° d publicati n:

(à n'utiliser que pour les commandes de reproduction)

2 694 692

(21) N° d'enregistrem nt national :

92 10115

(51) Int CI<sup>5</sup> : A 61 K 7/48, 7/04

(12)

# DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

**A1** 

- 22) Date de dépôt : 13.08.92.
- (30) Priorité :

- 71) Demandeur(s): THOREL Jean-Noël FR.
- Date de la mise à disposition du public de la demande : 18.02.94 Bulletin 94/07.
- 56 Liste des documents cités dans le rapport de recherche préliminaire : Se reporter à la fin du présent fascicule.
- Références à d'autres documents nationaux apparentés :
- (72) Inventeur(s) : THOREL Jean-Noël.
- 73) Titulaire(s) :
- (74) Mandataire : Cabinet Germain & Maureau.
- (54) Préparation cosmétique de nutrition de la peau.
- (57) Préparation cosmétique, comprenant une composition de nutrition de la peau, comportant au moins un acide gras essentiel, caractérisée en ce que la composition de nutrition comporte aussi des oligo-éléments et/ou des macroéléments chelatés par au moins un acide aminé dermocompatible, et au moins un composé vitaminé, actif vis-àvis du métabolisme cellulaire de la peau.

FR 2 694 692 - A'

1

# Préparation cosmétique de nutrition de la peau

La présente invention concerne une préparation cosmétique de nutrition de la peau.

On sait qu'une bonne nutrition cosmétique contribue au bon fonctionnement de la peau, en évitant notamment différentes affections cutanées. Or l'absorption orale d'aliments, progressivement digérés dans le tractus gastro-intestinal, et passant finalement par la voie hépa-10 tique, ne peut apporter des nutriments que dans les souscouches de la peau, puisque les couches supérieures de cette dernière ne sont pas vascularisées.

Une peau mal nutrie est une peau atone, flasque, manquant de souplesse. C'est aussi une peau délipidée, ce 15 qui diminue l'hydration cutanée et la cohésion cellulaire. Tout ceci contribue à affaiblir le rôle de barrière et les défenses de la peau, vis-à-vis de toutes les agressions et autres sensibilisations extérieures.

La dénutrition de la peau manifeste aussi 20 vieillissement de la peau. Les enzymes en effet ne sont plus synthétisées en aussi grande quantité et certaines deviennent inactives, ce qui diminue l'assimilation de certains nutriments, dont les acides gras.

Jusqu'à présent, on s'est surtout intéressé aux 25 besoins de la peau en nutriments énergétiques, en particulier en lipides, notamment en acides gras essentiels. On sait par exemple que toute carence nutritionnnelle de la peau en acides gras peut provoquer la chute des cheveux, des eczémas et l'hyperperméabilité de la peau à l'humi-30 dité. En conséquence, différents produits comprenant des acides gras polyinsaturés ont déjà été proposés, tels que shampooings, produits pour le bain et la douche, etc.

Mais il ne suffit pas de nourrir l'épiderme, encore faut-il lui apporter d'autres micronutriments, non 35 synthétisés par l'organisme, et dont il faut compenser les pertes quotidiennes. Ces micro-nutriments interviennent en

5

particulier dans une multitude de réactions biologiques au sein du derme et de l'épiderme, et sont finalement nécessaires à l'équilibre physiologique de l'épiderme.

Une préparation cosmétique selon l'invention com-5 porte une composition de nutrition de la peau constituée par :

- un ou plusieurs acides gras essentiels,
- des oligo-éléments et/ou des macro-éléments chelatés par au moins un acide aminé dermo-compatible, et au 10 moins un composé vitaminé, actif vis-à-vis du métabolisme cellulaire de la peau.

Le composé vitaminé est choisi parmi les composés des vitamines A, E, C, B1, PP, B5, B6, B8, et/ou leurs provitamines.

L'oligo-élément et/ou le macro-élément sont choisis parmi les métaux suivants, à savoir Zn, Cu, Mn, Fe, Mg, Ca, Se.

Le ou les acides gras essentiels sont choisis parmi les lipides riches en acides linoléique et/ou lino20 lénique, notamment l'huile de cynorhodon, l'huile de soja, et les fractions insaponifiables d'huile d'olive.

Avantageusement, la préparation cosmétique selon l'invention comprend aussi un complexe antiradicalaire comprenant un bioflavonoïde.

Avantageusement, la composition de nutrition de la peau, constituant la matière active de la préparation, représente au moins 10% en poids de cette dernière, le reste étant constitué par un véhicule approprié au transfert intra-dermique de la composition.

30

Plus précisément, une composition de nutrition selon l'invention comprend :

		Exemple	Fourchette de composition
	1 Vitamines		
	Vitamine A Palmitate	0.3%	0.01 - 2%
5	Vitamine E acétate	0.5%	0.01 - 10%
	Ascorbosinane C (Vitamine C + silicium organique)	1.0%	0.10 - 10%
	Vitamine B1	0.01%	0.001 - 2%
	Vitamine PP	0.1%	0.01 - 5%
10	Panthenol 75 (vitamine B5)	0.5%	0.01 - 5%
	Vitamine B6	0.3%	0.01 - 5%
	Vitamine B8	0.005%	0.001 - 1%
	Total	2.715%	
	2 Acides gras essentiels		
15	Vitamine F		
	Huile de rosier muscat	2%	0.1 - 10%
	Huile de soja	13%	0.1 - 50%
	Total	15%	
	3 Oligo-éléments		
20	Zn Chelate à 20%	0.05 %	0.001 - 5%
		(soit 100mg/kg)	
	Cu Chelate à 3%	0.01%	0.001 - 5%
		(soit 3mg/kg)	
	Mn Chelate à 16%	0.0001%	0.001 - 5%
25		(soit 0.8mg/kg)	
	Fe Chelate à 18%	0.0001%	0.001 - 5%
		(soit 0.18mg/kg)	
	Mg Chelate à 10%	0.05%	0.001 - 5%
		(soit 50mg/kg)	
30	Ca Chelate à 14%	0.01%	0.001 - 5%
		(soit 14mg/kg)	
	Total	0.12%	0.006 - 30%
	4 Insaponifiables d'huile		
	<u>d'olive</u>	2.0%	0.1 - 15%
35	5 Complexe anti-radicalaire Comprenant au moins un	0.3%	-
	bioflavonoïde		

4

A titre d'exemple, une préparation cosmétique selon l'invention comprend :

	Cire d'abeille	1,2
5	Huile de rosier muscat environ	2
	Huile de soja	13
	MT100 (dioxyde de titane micronisé)	0,1
	Insaponifiables d'huile d'olive	2
	Palmitate d'ascorbyle (vitamine C)	0,01
10	Acetate de tocopherol (vitamine E)	0,5
	Dow 344, cyclomethicone (silicone)	8
	Robufa 30n-3 oil (huile de poisson	0,04
	Abil EM 90 (silicone)	2,5
	Eau qsp	qsp 100
15	NaCl	0,5
	EDTA disodique	0,2
	Flavonoïde	0,05
	Vitamine B1 (chlorydrate de thiamine)	0,01
	Vitamine PP (nicotinamide)	0,1
20	Vitamine B6	0,3
	Vitamine B8 (d-biotine)	0,005
	Zn Chelate (chelate méthionine/histidine)	0,05
	Cu Chelate (chelate isoleucine/valine)	0,01
	Mg Chelate (chelate acide aspartique/glycine)	0,05
25	Ca Chelate (chelate histidine/lysine)	0,01
	Palmitate de vitamine a	0,3
	Ascorbosilane C (silicium + vitamine C)	1
	Phénoxyéthanol (conservateur)	0,1
	Panthenol 75 L (vitamine B5)	0,5
30	Parfum	0,3
	"Liqua par oil" (conservateur)	0,3

Une préparation selon l'invention permet d'apporter à chaque cellule de la peau l'essentiel des éléments 35 nécessaires à son bon fonctionnement, et notamment de manière concomitante des oligo-éléments et des vitamines. Grâce à l'invention, des substances normalement incompatibles, telles que vitamine A avec les métaux, et vitamine E et panthénol (B5) avec le cuivre et le fer, deviennent compatibles entre elles.

Les préparations selon l'invention se sont révélées, après différents essais, anallergiques, non comédogènes, et présentent une bonne tolérance cutanée et oculaire.

La forme chelatée des oligo-éléments permet d'aug-10 menter leur biodisponibilité, leur tolérance, et diminue leur éventuelle toxicité.

Ces préparations peuvent être obtenues selon toute forme physique ou texture appropriée, telle qu'émulsions, lotions, et crèmes.

15

5

Les vitamines sont des substances sans valeur énergétique propre, agissant à faibles doses et dont l'organisme ne peut pas effectuer la synthèse. Certaines d'entre elles ont un effet direct sur la peau. Une carence a des répercussions rapides sur les tissus cutanés.

Les vitamines employées selon l'invention se répartissent en deux groupes : les vitamines liposolubles et hydrosolubles.

#### 25 1) Les vitamines liposolubles

### Vitamine A palmitate ou acétate :

- action sur le maintien en bon état de la peau et des muqueuses ; une carence se traduit cliniquement par un dessechement de la peau et une hyperkératose donnant à la peau un aspect rugueux ; elle joue un rôle de régulateur dans la croissance, la différenciation et l'activité des cellules épithéliales,
- on lui attribue un rôle dans la synthèse des glycoprotéines situées sur la face externe des cellules, 35 ces molécules auraient un rôle dans la reconnaissance

entre les cellules, leur adhésion et l'échange de signaux entre elles.

# Vitamine E acétate:

- cette vitamine protège de l'oxydation les substances lipidiques et contribue par ce fait au bon état des tissus; elle s'oppose à la formulation de lipoperoxydes toxiques pour la cellule en captant le radical hydroxyle (ARL action),
- de plus, en s'intercallant au sein des membranes cellulaires, elle stope les propagations des réactions de péroxydation lipidiques; contrairement au lipéroxyde, elle capte les électrons en formant un radical chimiquement stable.

15

# 2) Les vitamines hydrosolubles

Ce groupe comprend les vitamines du goupe B et vitamine C. Elles sont facilement excrétées dans l'urine, du fait de leur nature hydrophile et de leur faible poids moléculaire. Les concentrations sont rarement élevées dans les tissus. Il n'existe pas ou peu de phénomènes d'hypervitaminose.

# Vitamine C (acide ascorbique) :

- elle possède de multiples actions au niveau tissulaire et des métabolismes cellulaires : elle participe à
  la défense de l'organisme contre les infections, est indispensable à la formation du collagène et à la protection
  contre les substances oxydantes ; c'est l'un des meilleurs
  capteurs de l'oxygène singulet (02) (ARL action),
- la transformation du pro-collagène en collagène nécessite l'hydroxylation de deux acides aminés : la proline et la lysine ; cette hydroxylation est nécessaire à la formation de la triple hélice de collagène ; la vitamine C joue un rôle essentiel dans cette transformation ; en son absence, le collagène synthétisé n'est pas capable

d'assurer la tonicité des tissus, la peau devient flasque et molle.

# Vitamine B1 (thiamine) :

- elle stimule la croissance et le développement de toutes les cellules,
  - elle intervient comme coenzyme dans de nombreuses réactions et plus particulièrement dans le métabolisme des glucides.

10

# Vitamine B3 ou PP (acide nicotinique) :

Elle participe au métabolisme des protéines, des glucides et des lipides. Une carence se remarque très rapidement par de nombreux signes cutanés : érythème douloureux pouvant être prurigineux avec formation d'une peau rugueuse et brunâtre (Pellagre).

# Vitamine B5 (acide pantothénique) :

- présent dans tous les tissus, il entre dans la 20 composition du coenzyme A ; il est impliqué dans un grand nombre d'étapes du métabolisme ; sa présence est nécessaire au maintien du bon état de la peau, des cheveux et des muqueuses, ainsi qu'à une bonne cicatrisation,
- l'acide panthothénique favorise le renouvelle-25 ment de la peau sur la couche germinative (lame basale) située à la jonction dermo-épidermique; il est proposé dans le traitement ds alopécies (en association avec la vitamine BB ou biotime), des troubles des phanères et de la cicatrisation.

30

# Vitamine B6 (pyridoxine) :

Elle participe surtout au métabolisme des acides aminés. Son effet au niveau cutané est très semblable à celui de la vitamine B2. Sa carence est liée à l'apparition de peaux à tendance acnéique sensible aux dermites séborrhéiques et de l'acné.

# Vitamine B8 ou H (biotine):

- la biotine joue sans aucun doute un rôle primordial pour le maintien de l'intégralité de la peau et des phanères,
- elle participe au niveau cellulaire à de multiples réactions; la peau en contient de grandes quantités et sa carence se matérialise par une dermite squameuse, avec sécheresse de la peau et des muqueuses; cette vitamine est particulièrement recommandée pour le traitement des affections séborrhéiques.

### β carotène :

- le  $\beta$  carotène n'est pas une vitamine à propre-15 ment parler, mais une molécule de  $\beta$  carotène se transforme en deux molécules de vitamine A.
- le β carotène a par ailleurs une action antioxydante remarquable; c'est l'un des meilleurs capteurs
  de l'oxygène singulet avec la vitamine A; l'oxygène sin20 gulet n'est pas un radical libre car il ne possède pas
  d'électron célibataire, mail il est très réactif et doit
  être éliminé rapidement (anti ARL, ou anti radicaux
  libres).
- Les minéraux employés selon l'invention ont une fonction nutritive primordiale. Ce sont des biocatalyseurs présents dans l'organisme partout où se trouve une réaction enzymatique. Leur rôle est de favoriser toutes ces réactions par leur simple présence, sans participation effective dans les réactions biochimiques.
  - On les sépare en deux catégories : les oligoéléments et les macro-éléments.

### 1) Les oligo-éléments

Ce sont : le zinc, le cuivre, le fer, l'iode, le chrome, le sélénium, le molybdène, le manganèse.

# 5 <u>Le zinc</u>:

- c'est un élément qui active environ 80 métalloenzymes, notamment la super-oxyde dismutase (SOD), ce qui lui confère un pouvoir anti-oxydant indirect,
- il joue le rôle dans le processus de cicatrisa10 tion et de croissance de la cellule,
  - il intervient dans la normalisation du taux de sébum chez les sujets ayant une peau à tendance grasse.
- les besoins quotidiens sont d'environ 15 mg/jour par voie orale ; on peut donc penser que les besoins 15 cutanés sont d'environ 2,5 mg/jour pour l'ensemble du tissu cutané.

#### Le cuivre :

- il intervient dans le métabolisme du tissu
   20 conjonctif en activant de nombreuses enzymes : cytochrome oxydase, superoxyde dismutase, cytochrome C oxydase, etc.
- les besoins quotidiens sont d'environ 2 à 3 mg/jour par voie orale; on peut donc penser que les besoins cutanés sont d'environ 0,3 mg/jour pour l'ensemble 25 du tissu cutané.

#### Le fer :

- c'est un élément participant à la formation d'hémoglobine, vecteur de l'oxygénation des cellules, il 30 catalyse également la formation du collagène, comme la vitamine C,
- les besoins quotidiens sont d'environ 25 mg/jour par voie orale; on peut donc penser que les besoins cutanés sont d'environ 5 mg/jour pour l'ensemble du tissu 35 cutané.

#### Le manganèse :

- il active de nombreux systèmes enzymatiques : Mn-super-oxyde dismutase (anti-oxydant, anti ARL),
- il joue un rôle dans la synthèse des mucopolysaccharides (structure de tissus),
  - les besoins quotidiens sont d'environ 5 mg/jour par voie orale ; on peut donc penser que les besoins cutanés sont d'environ 0,85 mg/jour pour l'ensemble du tissu cutané.

10

#### Le sélénium :

- comme tous les oligo-éléments, il participe au bon fonctionnement des systèmes enzymatiques, mais plus particulièrement à celui de la glutathion-péroxydase 15 (anti-oxydant),
  - il stabilise la vitamine E,
  - il possède des fonctions immunitaires,
  - il stabilise la kératine,
- les besoins quotidiens sont estimés 100 à 20 200  $\mu$ g/jour environ ; par voie orale on peut donc penser que les besoins sont d'environ 15 à 35  $\mu$ g/jour pour l'ensemble du tissu cutané.

#### 2) Les macro-éléments

Ce sont le calcium, le potassium et le magnésium.

Ils sont présents en quantité plus importante dans l'organisme.

#### Le magnésium :

- 30 c'est un facteur de croissance cellulaire,
  - il active de nombreuses métalloenzymes,
  - il joue un rôle protecteur vis-à-vis de la vitamine E,
- les besoins quotidiens sont d'environ 35 400 mg/jour par voie orale ; on peut donc penser que les

besoins cutanés sont d'environ 60 mg/jour pour l'ensemble du tissu cutané.

# Le calcium :

- 5 il participe à la constitution et à l'entretien de la trame osseuse et dentaire, au maintien de l'intégrité de la membrane cellulaire,
- les besoins quotidiens sont d'environ 900 mg/jour par voie orale ; on peut donc penser que les 10 besoins cutanés sont d'environ 150 mg/jour pour l'ensemble du tissu cutané.

# Le silicium:

- c'est un élément très important, que l'on 15 retrouve dans l'ensemble des éléments consitutifs de l'épiderme et du derme, qui disparait lentement avec l'âge; son rôle est multiple : il permet de normaliser les métabolismes cellulaires, de régénérer et de réparer les tissus,
- il augmente la quantité d'AMP<sub>C</sub> et permet ainsi de stimuler l'ensemble du métabolisme cellulaire,
  - il a une action antiradicalaire et protège ainsi la cellule.
- c'est un produit hydratant original car il per met d'augmenter la quantité d'eau liée à l'intérieur des tissus cutanés, améliorant ainsi les propriétés biomécaniques de la peau.
- Ies acides gras essentiels sont aussi appelés vitamine F. Les acides, linoléique C18:2 n-6, α linoléique C18:3 n-3 et gamma linolénique C18:3 n-6, sont essentiels pour les cellules car elles ne peuvent les synthétiser, et ils sont les éléments de base à la constitution des phospholipides membranaires ainsi que de nombreux médiateurs cellulaires, comme les prostaglandines, leuco-

triènes, thromboxanes. Ces molécules sont très actives à faibles doses dans l'environnement immédiat de la cellule qui les a produites. Elles participent aux réactions inflammatoires (effet antiradicalaire et régulateur), à la coaquilation sanguine, au phénomène de vasodilatation.

Les insaponifiables d'huile d'olive franchissent la jonction dermo-épidermique et atteignent le dermoréticulaire où se situent les fibres de collagène et 10 d'élastine. Ils stimulent la synthèse de ces mêmes fibres dont l'altération est à l'origine du vieillissement de la peau.

Ces produits sont particulièrement recommandés pour les peaux à tendance sèche et rugueuse. Les résultats 15 sont spectaculaires au niveau des mains.

En résumé, une composition de nutrition selon l'invention comprend par exemple :

#### 1) Vitamines

20 Vitamine A palmitate

Vitamine E acétate

Ascorbosilane C (Vitamine C + Silicium organique)

Vitamine B1

Vitamine PP

25 Penthenol 75 (Vitamine B5)

Vitamine B6

Vitamine B8 (Biotine)

Beta Carotène ou Provitamine A

#### 2) Eléments minéraux

30 Zn Chelate

Cu Chelate

Mn Chelate

Fe Chelate

Mg Chelate

35 Ca Chelate

Se Complexe

3) Acides gras essentiels

Vitamine F

Huile de Cynorhodon C18:3 Huile de Soja

5

4) Eventuellement un complexe anti-radicalaire, à base de bioflavonoïdes

Les préparations selon l'invention conviennent à 10 tous les types de peau, et plus spécifiquement :

- les peaux dénutries, atones, fines et délipidées
- les peaux sensibilisées par manque de nutrition cosmétique
  - les peaux agées
- et les peaux exposées à des conditions difficiles (vent, froid, etc).

Ces préparations s'appliquent sur une peau parfaitement nettoyée et séchée.

#### REVENDICATIONS

- 1) Préparation cosmétique, comprenant une composition de nutrition de la peau, comportant au moins un acide gras essentiel, <u>caractérisée en ce que</u> la composition de nutrition comporte aussi des oligo-éléments et/ou des macro-éléments chelatés par au moins un acide aminé dermocompatible, et au moins un composé vitaminé, actif vis-àvis du métabolisme cellulaire de la peau.
- 2) Préparation selon la revendication 1, caracté-10 risée en ce que le composé vitaminé est choisi parmi les composés des vitamines A, E, C B1, PP, B5, B6, B8, et/ou leurs provitamines.
- 3) Préparation selon la revendication 1, caractérisée en ce que l'oligo-élément et/ou le macro-élément 15 sont choisis parmi les métaux suivants, à savoir Zn, Cu, Mn, Fe, Mg, Ca, Se.
  - 4) Préparation selon la revendication 1, caractérisée en ce que l'acide gras essentiel est choisi parmi les lipides riches en acides linoléiques et/ou linolénique, notamment l'huile de cynorhodon, l'huile de soja, et les fractions insaponifiables d'huile d'olive.
    - 5) Préparation selon la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle comprend un complexe antiradicalaire comprenant au moins un bioflavonoïde.
- of) Préparation selon la revendication 1, caractérisée en ce que la composition de nutrition de la peau représente au moins 10% en poids de ladite préparation, dont le reste est constitué par un véhicule approprié au transfert intra-dermique de ladite composition.

# REPUBLIQUE FRANÇAISE

2694692

Nº d'enregistrement national

# **INSTITUT NATIONAL**

de la

PROPRIETE INDUSTRIELLE

# RAPPORT DE RECHERCHE

établi sur la bas des dernières revendications déposées avant le commencement de la recherche FR 9210115 475343

atégorie	Citation du document avec indication, en cas d	concern de la de examin	mande
	des parties pertinentes		*
۱ ۱	EP-A-0 330 583 (L'OREAL) * le document en entier *	1-6	
١.	EP-A-0 092 085 (SOCIETE DES PR NESTLE) * le document en entier *	ODUITS 1-6	
`	EP-A-0 279 136 (CLARINS) * le document en entier *	1-6	
١	EP-A-0 085 579 (HORROBIN) * le document en entier *	1-6	
			DOMAINES TECHNIQUE RECHERCHES (Int. Cl.5)
			A61K
		ent de la recherche RIER 1993	Examinates: FISCHER J.P.
X : parti Y : parti	ATEGORIE DES DOCUMENTS CITES  cullèrement pertinent à lui seul cullèrement pertinent en combinaison avec un e document de la même catégorie	T: théorie ou principe à la ba E: document de brevet bénéfi à la date de dépôt et qui n de dépôt ou qu'à une date D: cité dans la demande	ciant d'une date antérieure la été publié qu'à cette date

1

O : divulgation non-écrite
P : document intercalaire

& : membre de la même famille, document correspondant